

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

Patent Abstracts of Japan

PUBLICATION NUMBER : 56083467  
PUBLICATION DATE : 08-07-81

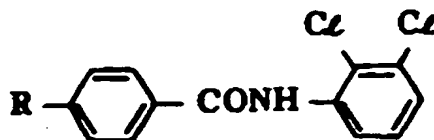
APPLICATION DATE : 10-12-79  
APPLICATION NUMBER : 54159270

APPLICANT : HODOGAYA CHEM CO LTD;

INVENTOR : KANASHIKI TOSHITAKA;

INT.CL. : C07C143/68 A01N 41/02 C07C143/86

TITLE : BENZAMIDE DERIVATIVE AND  
HERBICIDE CONTAINING THE SAME



ABSTRACT : NEW MATERIAL: A benzamide derivative of the formula (R is alkylsulfonyloxy, halo-substituted alkylsulfonyloxy, alkyl-substituted phenylsulfonyloxy, etc.).

EXAMPLE: 4-Methylsulfonyloxy-N-(2,3-dichlorophenyl)-benzamide.

USE: A highly selective herbicide capable of suppressing the germination and growth of weeds and exhibiting a remarkable control effect on gramineous weeds, e.g. a barnyard grass, and monochoria of the family Pontederiaceae, etc. by the soil treatment under flooded conditions and inhibitory effects on broadleaf weeds such as long stemmed water-wort. Little phytotoxicity to transplanted rice plants.

PROCESS: Potassium salt of 4-hydroxy-N-(2,3-dichlorophenyl)-benzamide is reacted with various sulfonyl chlorides in the presence or absence of a basic salt in an organic solvent to give the compound of the formula.

⑨ 日本国特許庁 (JP)  
⑫ 公開特許公報 (A)

⑪ 特許出願公開  
昭56—83467

⑤ Int. Cl.<sup>3</sup>  
C 07 C 143/68  
A 01 N 41/02  
C 07 C 143/86

識別記号

庁内整理番号  
7162—4H  
7142—4H  
7162—4H

⑬ 公開 昭和56年(1981)7月8日

発明の数 2  
審査請求 未請求

(全 4 頁)

⑭ ベンズアミド誘導体およびそれを含有する除草剤

⑯ 特 願 昭54—159270  
⑯ 出 願 昭54(1979)12月10日  
⑯ 発 明 者 竹松哲夫  
宇都宮市峰町3の612  
⑯ 発 明 者 保谷正明

宇都宮市石井町2992—59  
⑯ 発 明 者 金敷利隆  
東京都北区王子6丁目2番30号  
保土谷化学工業株式会社中央研  
究所内  
⑯ 出 願 人 保土谷化学工業株式会社  
東京都港区虎ノ門1丁目4番2  
号

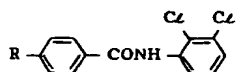
明 細 書

1. 発明の名称

ベンズアミド誘導体およびそれを含有する除草剤

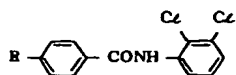
2. 特許請求の範囲

1. 一般式



(式中の R は、アルキルスルホニルオキシ基、ハロ置換アルキルスルホニルオキシ基、アルキル置換フェニルスルホニルオキシ基、アルキルサルファモイルオキシ基を示す。) で表わされるベンズアミド誘導体。

2. 一般式



(式中の R は、アルキルスルホニルオキシ基、ハ

ロ置換アルキルスルホニルオキシ基、アルキル置換フェニルスルホニルオキシ基、アルキルサルファモイルオキシ基を示す。) で表わされるベンズアミド誘導体を含有する除草剤。

3. 発明の詳細な説明

本発明は特定のベンズアミド誘導体およびそのベンズアミド誘導体を含有する除草剤に関するものである。

本発明者らは、各種の化合物について除草活性を検討していたところ、特定のベンズアミド誘導体の特異な作用を見出し、本発明を完成させるに至った。

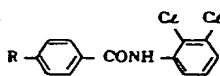
すなわち、本発明における第一の発明は、次に示すベンズアミド誘導体であり、第二の発明は、そのベンズアミド誘導体を有効成分とする除草剤である。


一般式



(式中のRは、アルキルスルホニルオキシ基、ハロ置換アルキルスルホニルオキシ基、アルキル置換フェニルスルホニルオキシ基、アルキルサルファモイルオキシ基を示す。)

次に、本発明に係るベンズアミド誘導体の代表的なものを示す。なお、表中の構造式については、便宜上置換基のみを示す。



化合物 番号	R	物 性
1	CH <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> -	m.p. 148~151℃
2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> SO <sub>2</sub> -	m.p. 117~119
3	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> SO <sub>2</sub> -	m.p. 111~113
4	iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> SO <sub>2</sub> -	m.p. 127~129.5
5	n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub> SO <sub>2</sub> -	m.p. 107.5~109
6	CH <sub>3</sub> -  -SO <sub>2</sub> -	m.p. 168.5~170.5


-3-

ン4ccを50ccの4つ口フラスコに仕込み、室温で攪拌したまま、この中に、メチルスルホニルクロライド0.3ccとアセトン4ccの溶液を少しずつ滴下していった。滴下終了後、反応液を加熱していき、アセトンが還流するような状態で6時間加熱攪拌をして反応を終了させた。反応終了後、反応液中のアセトンを、ロータリーエバポレーターにて蒸発除去し、この残査を酢酸エチル約200ccに溶解した。この酢酸エチルの溶液を、水を少し加えながら3ccの水酸化ナトリウム水溶液100cc×3回及び水100cc×3回で洗浄し、その後、無水硫酸ナトリウムで脱水処理した後、酢酸エチルを蒸発除去し、目的物の、4-メチルスルホニルオキシ-N-(2,3-ジクロロフェニル)-ベンズアミド0.68gを得た。収率86.3%、融点148~151℃であつた。

#### 合成例2

4-ヒドロキシ-N-(2,3-ジクロロフェニル)-ベンズアミドのカリウム塩0.7g、硫酸カリウム0.31g、テトラヒドロフラン4ccを室温

特開昭56- 83467(2)

化合物 番号	R	物 性
7	CCl <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> -	m.p. 261.5~264.5
8	 N <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -	m.p. 151~153

本発明の化合物は、4-ヒドロキシ-N-(2,3-ジクロロフェニル)-ベンズアミドのカリウム塩と、各種のスルホニルクロライド、サルファモイルクロライドとを、硫酸カリウム等の塩基性塩類の存在下、または非存在下で、アセトン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド等の有機溶媒中で反応させることによつて、簡単に、しかも高収率、高純度で得ることができる。

次に、その代表的な合成例を示す。

#### 合成例1

4-ヒドロキシ-N-(2,3-ジクロロフェニル)-ベンズアミドのカリウム塩0.7gとアセト

-4-

で攪拌したまま、この中に、ジメチルスルファモイルクロライド0.5ccとテトラヒドロフラン2ccの溶液を滴下していく。滴下終了後、反応液を加熱して、テトラヒドロフランが還流する状態で、8時間ほど加熱攪拌をして反応を終了させた。反応終了後、反応液中のテトラヒドロフランを蒸発除去し、残査を約200ccのベンゼンに溶解した。このベンゼン溶液を、3%水酸化ナトリウム水溶液100cc×3回及び水100cc×3回で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで脱水、処理した後、溶剤を蒸発除去した。この残査をベンゼンにて再結晶することにより目的物の4-ジメチルスルファモイルオキシ-N-(2,3-ジクロロフェニル)-ベンズアミド0.67gを得た。収率78.7%、融点151~153℃であつた。

#### 合成例3

4-ヒドロキシ-N-(2,3-ジクロロフェニル)-ベンズアミドのカリウム塩0.5gと硫酸カリウム0.22g、アセトン4ccの混合溶液を室温で攪拌しながら、このなかで、p-トルエンス

-6-

ルホニルクロライド0.45gとアセトン4ccの混合液を添加した。その後、室温のまま7時間程攪拌して反応を終了させた。反応終了後、反応液をロータリーエバポレーターで蒸発乾固し、蒸発残渣に酢酸エチル200ccを加えてよく溶解したのちに、この酢酸エチル溶液を、分液漏斗にて、3% NaOH 100cc×5回、次に、水道水100cc×3回でよく洗浄し、その後、酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで脱水処理し、溶液を蒸発乾固し、得られた蒸発残渣をベンゼンにて再結晶を行なうと、目的物の4-(p-トルエンスルホニルオキシ)-N-(2,3-ジクロロフェニル)-ベンズアミドが0.49g得られた。収率71.9%、融点168.5~170.5℃であつた。

本発明の除草剤は、有効成分化合物を各種担体と混合して、水和剤、乳剤、粉剤、粒剤などの形態に製剤化して得られる。担体のうち、液状担体としては、通常の有機溶媒、固体担体としては、通常の賦物質質粉が使用される。また、製剤製造に際して乳化性、分散性、展着性等を付与するた

-7-

キャリアーを得た。

上記の如くして得られた水和剤用キャリアー90重量部と、4-(p-トルエンスルホニルオキシ)-N-(2,3-ジクロロフェニル)-ベンズアミド10重量部とを均一に粉砕混合して、水和剤を得た。

#### 製剤例2 (乳剤)

4-(p-トルエンスルホニルオキシ)-N-(2,3-ジクロロフェニル)-ベン

ズアミド 10重量部  
シクロヘキサノン 40重量部  
キシレン 40重量部  
ソルボール800A 10重量部

以上の成分を均一に混合溶解して、乳剤を得た。

#### 試験例

1/15,500 アールの田製ポットに水田土壌をつめ、表層にノビエ、ヌメリグサ、アゼガヤおよびコナギの種子を均一に播種し、2cmの深さに灌水した。さらに発令2葉期の水稻苗(品種:日本晴)を2本移植した。その後、雑草の発芽時に、各被

-9-

#### 特開昭56- 83467(3)

めに界面活性剤を添加できる。さらに、肥料、除草剤、殺虫剤、殺菌剤などの農薬と混合して使用することもできる。

本発明の除草剤は、主として雑草の発芽および生長を抑制し、特に湛水条件下における土壌処理で、ノビエ、ヌメリグサ、アゼガヤなどのイネ科雑草およびミズアオイ科のコナギ等に卓越した防除効果を示すばかりでなく、ミゾハコベ、ヤカシグサ等の広葉雑草にも生長抑制効果が見られ、しかも、移植水稻に対する薬害はほとんど見られない、高度選択性除草剤である。

次に本発明の除草剤を製剤例および試験例によつて説明する。

#### 製剤例1 (水和剤)

ジークライト 97重量部  
ネオベレックスパウダー 1.5重量部  
(商標名:花王アトラス製)  
ソルボール800A 1.5重量部  
(商標名:東邦化学工業製)

以上の成分を均一に粉砕混合して、水和剤用の

-8-

検化合物の水和剤希釈液を、各薬剤の所定量だけ、水中に湛下処理した。薬剤処理後20日目に、ノビエ、ヌメリグサ、アゼガヤおよびコナギに対する除草効力、ならびに移植水稻の薬剤に対する反応を下記の基準によつて観察調査を行なつた。

除草効果	移植水稻の被害
0: 無(効果なし)	-: 無害
1: 微	±: 微害
2: 小	+: 小害
3: 中	#: 中害
4: 大	##: 大害
5: 極大(100%除草)	

この結果を次の表に示す。

-10-

特開昭56- 83457(4)

手 続 補 正 書 (自発)

昭和55年 7 月 24 日

特許庁長官 川 原 能 雄 殿

1. 事件の表示

昭和54年特許願第159270号

2. 発明の名称

ベンズアミド誘導体およびそれを含む除草剤

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

郵便番号 105

住 所 東京都港区虎ノ門一丁目4番2号

名 称 (531) 保土谷化学工業株式会社

代表者 取締役社長 森 本 俊 夫

電 話 504-8723

4. 補正命令の日付

昭和 年 月 日



化合物 No.	処理量 g/10a	水 稲 薬 害	除 草 効 果			
			ノビエ	スメリグサ	アゼガヤ	コナギ
1	1000	±	5	5	5	5
	500	—	5	5	5	5
	250	—	5	5	5	4
	125	—	5	5	5	4
2	1000	—	5	5	5	5
	500	—	5	5	5	5
	250	—	5	5	5	5
	125	—	5	5	5	5
3	1000	—	5	5	5	5
	500	—	5	5	5	5
	250	—	5	5	5	5
	125	—	5	5	5	5
4	1000	—	5	5	5	5
	500	—	5	5	5	5
	250	—	5	5	5	5
	125	—	5	5	5	5
5	1000	—	5	5	5	5
	500	—	5	5	5	5
	250	—	5	5	5	5
	125	—	5	5	5	4.5~5
8	1000	—	5	5	5	5
	500	—	5	5	5	5
	250	—	5	5	5	5
	125	—	5	4.5	5	4.5

保土谷化学工業株式会社

-11-

5. 補正により増加する発明の数 な し

6. 補正の対象 明細書の発明の詳細な説明の欄

7. 補正の内容

(1) 明細書第4ページの表の下部に次のものを加入する。

9	CP <sub>4</sub> 80 <sub>4</sub> -	m.p. 129~131
10	CLC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> 80 <sub>4</sub> -	m.p. 112~114.5

(2) 明細書第11ページの表の下部に次のものを加入する。

9	1000	—	5	5	5	5
	500	—	5	5	5	5
	250	—	4.5~5	4.5	5	4.5
	125	—	4.5	4.5	4.5	4.5
10	1000	—	5	5	5	5
	500	—	5	5	5	5
	250	—	5	5	5	4.5~5
	125	—	4.5~5	4.5	4.5~5	4.5

保土谷化学工業株式会社

-2-